

	カプセル50mg	カプセル100mg
*承認番号	22500AMX01042000	22500AMX01043000
*薬価収載	2013年12月	2013年12月
販売開始	2008年7月	2006年7月

アレルギー性疾患治療剤

**\* スプラタストシル酸塩カプセル50mg「JG」**  
**\* スプラタストシル酸塩カプセル100mg「JG」**

〔貯法〕  
室温保存(吸湿性が強いので、  
開封後は吸湿に注意すること。)  
〔使用期限〕  
外箱に表示の  
期限内に使用すること。

(スプラタストシル酸塩製剤)

**【禁忌(次の患者には投与しないこと)】**  
本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

(7)本剤を季節性アレルギー性疾患患者に投与する場合は好発季節を考え、その直前から投与を開始し、好発季節終了時まで続けることが望ましい。

**3.副作用**

本剤は使用成績調査等の副作用発現頻度が明確となる調査を実施していない。

(1) **重大な副作用** (頻度不明)

- 1) **肝機能障害**: 黄疸、ALT(GPT)上昇、AST(GOT)上昇、 $\gamma$ -GTP上昇、Al-P上昇、LDH上昇等の**肝機能障害**(初期症状: 全身倦怠感、食欲不振、発熱、嘔気等)があらわれることがあるので、観察を十分に行い、異常が認められた場合には投与を中止するなど適切な処置を行うこと。
- 2) **ネフローゼ症候群**: ネフローゼ症候群があらわれることがあるので、観察を十分に行い、異常が認められた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。

(2) **その他の副作用**

次の副作用があらわれることがあるので、異常が認められた場合には減量、休薬等の適切な処置を行うこと。なお、過敏症があらわれた場合には投与を中止すること。

	頻度不明
消化器	胃部不快感、嘔気、胃痛、下痢、口渇、食欲不振、口内炎、腹痛、嘔吐、腹部膨満感、舌のあれ
精神神経系	眠気、頭痛、痙攣、振戦、めまい、しびれ
血液	白血球減少、好酸球增多
過敏症	発疹、痒痒感、蕁麻疹
肝臓	AST(GOT)上昇、ALT(GPT)上昇、 $\gamma$ -GTP上昇、LDH上昇、ビリルビン上昇、Al-P上昇
泌尿器	蛋白尿、頻尿
その他	生理不順、倦怠感・脱力感、浮腫、耳鳴、眼瞼乾燥感、発熱、ほてり、鼻出血、味覚異常、口臭、動悸、咳、胸部圧迫感

**4.高齢者への投与**

一般に高齢者では生理機能が低下しているため、低用量(例えば150mg/日)から投与を開始し、増量する場合は患者の副作用及び臨床症状を十分観察しながら行うこと。

**5.妊婦、産婦、授乳婦等への投与**

- (1)妊婦又は妊娠している可能性のある婦人には治療上の有益性が危険性を上回ると判断される場合にのみ投与すること。〔妊娠中の投与に関する安全性は確立していない。〕
- (2)授乳婦に投与する場合には授乳を中止させること。〔動物実験(ラット)で乳汁中への移行が報告されている。〕

**6.小児等への投与**

低出生体重児、新生児、乳児、幼児又は小児に対する安全性は確立していない。(使用経験が少ない。)

**7.臨床検査結果に及ぼす影響**

本剤の投与はアレルギー性皮膚内反応を抑制し、アレルギーの確認に支障をきたすので、アレルギー性皮膚内反応検査を実施する前は本剤を投与しないこと。



**8.適用上の注意**

薬剤交付時: PTP包装の薬剤はPTPシートから取り出して服用するよう指導すること。〔PTPシートの誤飲により、硬い鋭角部が食道粘膜へ刺入し、更には穿孔をおこして縦隔洞炎等の重篤な合併症を併発することが報告されている。〕

**9.その他の注意**

スプラタストシル酸塩からジメチルスルフィドが生じ、口臭が発現することがある。

**\*\*【組成・性状】**

販売名	スプラタストシル酸塩カプセル50mg「JG」	スプラタストシル酸塩カプセル100mg「JG」
成分・含量(1カプセル中)	スプラタストシル酸塩50mg	スプラタストシル酸塩100mg
添加物	乳糖水和物、トウモロコシデンプン、軽質無水ケイ酸、ステアリン酸マグネシウム、ゼラチン、酸化チタン、ラウリル硫酸ナトリウム	乳糖水和物、トウモロコシデンプン、軽質無水ケイ酸、ステアリン酸マグネシウム、ゼラチン、酸化チタン、マクロゴール4000、ラウリル硫酸ナトリウム
剤形・性状	キャップ部 白色不透明、ボディ部 白色不透明の硬カプセル剤 内容物にはおはいないか又はわずかに特異なおいのある白色の粉末	
外形		
カプセル号数	4号	3号
重量(mg)	135	199
識別コード	ch-se	ch-sh

**【効能・効果】**

気管支喘息、アトピー性皮膚炎、アレルギー性鼻炎

**【用法・用量】**

通常、成人にはスプラタストシル酸塩として1回100mgを1日3回毎食後に経口投与する。  
ただし、年齢、症状により適宜増減する。

**【使用上の注意】**

**1.慎重投与(次の患者には慎重に投与すること)**

肝障害のある患者〔肝障害が悪化するおそれがある。〕

**2.重要な基本的注意**

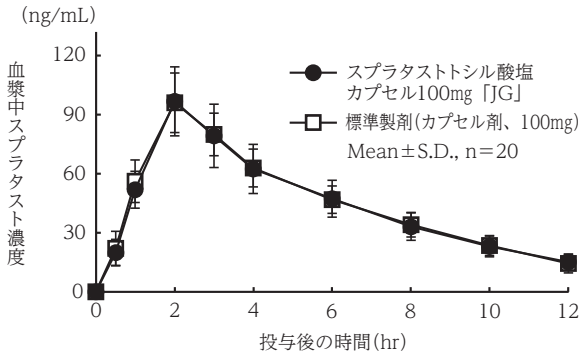
- (1)本剤は喘息の悪化時ばかりでなく、喘息が良好にコントロールされている場合でも継続して服用するよう、患者に十分説明しておくこと。
- (2)本剤は気管支拡張剤、ステロイド剤、抗ヒスタミン剤等と異なり、既に起こっている発作や症状を速やかに軽減する**薬剤ではない**ので、このことは患者に十分説明しておく必要がある。
- (3)気管支喘息患者に本剤を投与中、**大発作をみた場合は**気管支拡張剤あるいはステロイド剤を投与する必要がある。
- (4)長期ステロイド療法を受けている患者で、本剤投与によりステロイドの減量をはかる場合は十分な管理下で徐々に行うこと。
- (5)本剤の使用によりステロイド維持量を減量し得た患者で、本剤の投与を中止する場合は原疾患再発のおそれがあるので注意すること。
- (6)本剤の使用により効果が認められない場合には漫然と長期にわたり投与しないように注意すること。

**\*【薬物動態】**

**1. 生物学的同等性試験**

スプラタストトシル酸塩カプセル100mg「JG」と標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ1カプセル（スプラタストトシル酸塩として100mg）を健康成人男子に空腹時単回経口投与して血漿中スプラタスト濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ（AUC、Cmax）について90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、log (0.80)~log (1.25) の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。

また、スプラタストトシル酸塩カプセル50mg「JG」は、「含量が異なる経口固形製剤の生物学的同等性試験ガイドライン（平成12年2月14日医薬審第64号）」に基づき、スプラタストトシル酸塩カプセル100mg「JG」を標準製剤としたとき、溶出挙動が等しく、生物学的に同等とみなされた。<sup>1)</sup>



	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC <sub>0-12</sub> (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	t <sub>1/2</sub> (hr)
スプラタストトシル酸塩カプセル100mg「JG」	540.2 ± 72.0	98.4 ± 17.2	2.2 ± 0.4	4.2 ± 2.2
標準製剤(カプセル剤, 100mg)	548.2 ± 63.4	97.2 ± 14.1	2.1 ± 0.3	3.7 ± 1.1

(Mean ± S.D., n=20)

血漿中濃度並びにAUC、Cmax等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

**2. 溶出挙動**

スプラタストトシル酸塩カプセル50mg「JG」及びスプラタストトシル酸塩カプセル100mg「JG」は、日本薬局方外医薬品規格第3部に定められたスプラタストトシル酸塩50mgカプセル及びスプラタストトシル酸塩100mgカプセルの溶出規格に適合していることが確認されている。<sup>2)</sup>

**【有効成分に関する理化学的知見】**

一般名：スプラタストトシル酸塩 (Suprastat Tosilate)

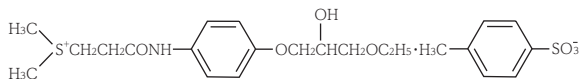
化学名：(RS)-[2-[4-(3-Ethoxy-2-hydroxypropoxy)-phenylcarbamoyl]ethyl]dimethylsulfonium p-toluenesulfonate

分子式：C<sub>16</sub>H<sub>26</sub>NO<sub>4</sub>S・C<sub>7</sub>H<sub>7</sub>O<sub>3</sub>S

分子量：499.64

融点：86～90℃

構造式：



性状：スプラタストトシル酸塩は白色の結晶性の粉末で、においはないか、又はわずかに特異なおいがある。水、メタノール又は酢酸(100)に極めて溶けやすく、エタノール(99.5)に溶けやすい。

水溶液(1→10)は旋光性を示さない。潮解性である。

**\*【取扱い上の注意】**

**安定性試験**

最終包装製品を用いた長期保存試験（室温保存、3年）の結果、外観及び含量等は規格の範囲内であり、スプラタストトシル酸塩カプセル50mg「JG」及びスプラタストトシル酸塩カプセル100mg「JG」の室温保存における3年間の安定性が確認された。<sup>3)</sup>

**\*【包装】**

スプラタストトシル酸塩カプセル50mg「JG」

PTP：100カプセル（10カプセル×10）

スプラタストトシル酸塩カプセル100mg「JG」

PTP：100カプセル（10カプセル×10）、

1000カプセル（10カプセル×100）

**【主要文献】**

- 1) 長生堂製薬株式会社 社内資料（生物学的同等性試験に関する資料）
- 2) 長生堂製薬株式会社 社内資料（溶出試験に関する資料）
- 3) 長生堂製薬株式会社 社内資料（安定性試験に関する資料）

**\*【文献請求先】**

主要文献に記載の社内資料につきましても下記にご請求下さい。

日本ジェネリック株式会社 お客様相談室  
〒100-6739 東京都千代田区丸の内一丁目9番1号  
TEL 0120-893-170 FAX 0120-893-172

\* 販売元

**JG** 日本ジェネリック株式会社  
東京都千代田区丸の内一丁目9番1号

製造販売元

**Chosei** 長生堂製薬株式会社  
徳島市国府町府中92番地